

# 特許協力条約

PCT

特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）

〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 03P00098W0	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP2004/019048	国際出願日 (日.月.年) 21.12.2004	優先日 (日.月.年) 22.12.2003
国際特許分類 (IPC) Int.Cl. <b>C07D413/04, 413/14, 417/04, 417/14, 405/12, 239/54, 487/04, A61K31/506, 31/519, A61P31/18</b>		
出願人 (氏名又は名称) 塩野義製薬株式会社		

<p>1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。</p> <p>2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で <u>3</u> ページからなる。</p> <p>3. この報告には次の附属物件も添付されている。</p> <p>a. <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。</p> <p><input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）</p> <p><input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとこの国際予備審査機関が認定した差替え用紙</p> <p>b. <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、電子形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。 (実施細則第802号参照)</p>	
<p>4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎</p> <p><input type="checkbox"/> 第II欄 優先権</p> <p><input type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成</p> <p><input type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如</p> <p><input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明</p> <p><input type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献</p> <p><input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備</p> <p><input type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見</p>	

国際予備審査の請求書を受理した日 21.02.2005	国際予備審査報告を作成した日 08.11.2005	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 伊藤 幸司	4C 9450
電話番号 03-3581-1101 内線 3452		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (2005年4月)

## 第 I 欄 報告の基礎

1. 言語に関し、この予備審査報告は以下のものを基礎とした。

- ☒ 出願時の言語による国際出願
- ☐ 出願時の言語から次の目的のための言語である \_\_\_\_\_ 語に翻訳された、この国際出願の翻訳文
- ☐ 国際調査 (PCT規則12.3(a)及び23.1(b))
- ☐ 国際公開 (PCT規則12.4(a))
- ☐ 国際予備審査 (PCT規則55.2(a)又は55.3(a))

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項
- ☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ
- ☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項
- ☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図
- ☐ 配列表 (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_
- ☐ 配列表に関連するテーブル (具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に "superseded" と記入されることがある。

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、  
それを裏付ける文献及び説明

## 1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲 1-22	有
	請求の範囲	無
進歩性 (IS)	請求の範囲 10-19	有
	請求の範囲 1-9, 20-22	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲 1-22	有
	請求の範囲	無

## 2. 文献及び説明 (PCT規則 70.7)

文献 1: WO 03/016275 A1 (塩野義製薬株式会社) 2003. 02. 27

文献 2: WO 03/035077 A1 (ISTITUTO DI RICERCHE DI BIOLOGIA MOLECOLARE P. ANGELETTI SPA) 2003. 05. 01

文献 3: WO 03/035076 A1 (ISTITUTO DI RICERCHE DI BIOLOGIA MOLECOLARE P. ANGELETTI SPA) 2003. 05. 01

## &lt;請求の範囲 1-9、20-22&gt;

請求の範囲 1-9 及び 20-22 に係る発明は、国際調査報告で引用された文献 1 より進歩性を有しない。

文献 1 には、HIV 等に対し抗ウイルス活性を有する化合物として、特に G 群化合物が例示されており(第 389-394 頁)、具体的に例示されている化合物はピリミジン環の 2 位がメチル基、即ち低級アルキル基で置換されている点で、請求の範囲 1-9 及び 20-22 に係る発明とは相違する。しかしながら、文献 1 には、ピリミジン環の 2 位は非妨害置換基で置換されており、低級アルキル基以外にもインテグラーゼ阻害活性を妨害しない置換基であれば特に限定されていないことについても言及されている(第 89-92 頁)。してみれば、文献 1 に記載された発明において、同様に抗 HIV 活性を有する化合物を提供するために、ピリミジン環の 2 位の非妨害置換基として低級アルキル基以外のものを選択してみることは当業者が容易になし得ることである。

そして、本願明細書には、膨大な数の化合物が想定される請求の範囲 1 の式(1)のうちごく一部の化合物が文献 1 に記載の化合物に比して IC50 及び EC50 の改善が見られた旨開示されているに過ぎず(表 1)、同(1)に含まれる化合物全体についても同等の改善されたウイルス活性を有することについて、また、文献 1 に開示のある他の化合物に対しても同等に IC50、EC50 に改善が見られることについては確認することができないのであるから、請求の範囲 1-9 及び 20-22 に係る発明の効果が、文献 1 に記載された発明から当業者にとって予測困難な格別顕著なものであるとは認められない。

## &lt;請求の範囲 10-19&gt;

請求の範囲 10-19 に係る発明は、国際調査報告で引用された何れの文献にも開示されておらず、新規性及び進歩性を有する。

特に、請求の範囲 1 の式(1)で表される化合物のうち R1 と R2 が隣接する原子と一緒になって置換されてもよい複素環を形成するもの、また、同式で表される化合物のうち X=(c)であるものについては、最も関連のある先行技術文献であると認められる文献 1-3 の何れにも開示されていない。